

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

① **BLACK BORDERS**

- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS

② **BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS**

- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

⑤1

Int. Cl. 2:

B 05 D 5/00

①9 **BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND**

B 05 D 1/36

B 05 D 7/24

A 61 K 9/42

DEUTSCHES PATENTAMT



DT 26 14 020 A 1

①1

Offenlegungsschrift 26 14 020

②1

Aktenzeichen: P 26 14 020.5

②2

Anmeldetag: 1. 4. 76

④3

Offenlegungstag: 20. 10. 77

③0

Unionspriorität:

③2 ③3 ③1 —

⑤4

Bezeichnung: Verfahren zur Isolierung von Presslingen

⑦1

Anmelder: Knoll AG, 6700 Ludwigshafen

⑦2

Erfinder: Suwa, Kaname, Narashino, Chiba (Japan)

⑤5

Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht zu ziehende Druckschriften:

DT-PS 8 63 986

DT-AS 20 64 373

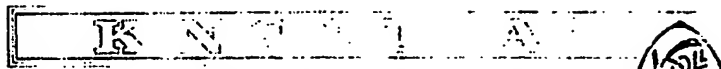
OE 2 82 060

OE 2 49 874

CH 5 62 614

US 34 37 728

DT 26 14 020 A 1



CHÉMISCHE FABRIKEN



2614020

P a t e n t a n s p r u c h

(Verfahren zur Isolierung von Presslingen gegen Feuchtigkeit, dadurch gekennzeichnet, dass man die Presslinge zuerst direkt und ohne Verwendung eines Lösungsmittels mit einer Schicht aus Wachs und einem öligen Medium überzieht und anschliessend die weiteren Überzüge in bekannter Weise aufbringt.

Dr. WK/bu

ORIGINAL INSPECTED

709842/0088



2614020

Patent- und Lizenz-Abteilung
P 178

Ludwigshafen am Rhein,
den 26. März 1976

Verfahren zur Isolierung von Presslingen

Es ist bekannt, Presslinge z.B. für Arzneimittel durch Überziehen mit polymeren Substanzen wie Schellack gegen Feuchtigkeit zu schützen [vgl. W. A. Ritschel: Die Tablette, Editor Cantor KG, Aulendorf (1966) Seite 365].

Diese polymeren Substanzen werden in Wasser oder organischen Lösungsmitteln auf die Presslinge aufgetragen. Die Verwendung von Wasser als Lösungsmittel ist jedoch in den meisten Fällen nicht möglich, weil entweder die Presslinge zu leicht wasserlöslich sind oder das Wasser nur unter Bedingungen entfernt werden kann, unter denen sich die Presslinge verändern. Auch die Verwendung organischer Lösungsmittel bringt Nachteile mit sich, da zur Vermeidung toxischer Rückstände in der Arzneizubereitung häufig eine thermische Nachbehandlung der Überzüge erforderlich ist und weil durch das Entfernen der organischen Lösungsmittel mit der Abluft eine Luftverschmutzung eintritt, die besonders in dicht besiedelten Gebieten - zu einer Beschränkung auf geringe Produktionsmengen führen kann. Die

709842/0088

- 2 -

LEBEN

CHEMISCHE FABRIKEN



2614020

Brennbarkeit und Toxizität der Lösungsmittel erfordert zudem eine Reihe kostspieliger Vorsichtsmassnahmen zum Schutz des Personals und der Produktionsanlagen.

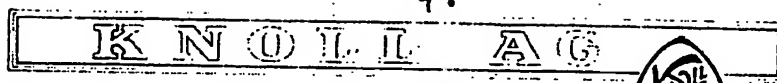
Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, Presslinge so gegen Feuchtigkeit zu isolieren, dass diese Nachteile nicht auftreten.

Diese Aufgabe wird erfindungsgemäss dadurch gelöst, dass man die Presslinge zuerst direkt und ohne Verwendung eines Lösungsmittels mit einer Schicht aus Wachs und einem öligen Medium überzieht und anschliessend die weiteren Überzüge in bekannter Weise aufbringt.

Das Überziehen der Presslinge mit dem Wachs und dem öligen Medium kann in den üblichen Einrichtungen zum Überziehen von Presslingen, z.B. Dragierkesseln, in bekannter Weise erfolgen.

Als Wachse [vgl. Römpf : Chemie-Lexikon, 6. Aufl. (1966) Seite 7042 f] kommen insbesondere Ceresin, Wollwachs, Paraffine, hydriertes Ricinusöl in Frage. Geeignete ölige Medien sind z.B. natürliche oder synthetische Öle wie acetylierte Monoglyceride und flüssige Gemische aus gesättigten Triglyceriden.

- f -
• 4.



CHEMISCHE FABRIKEN

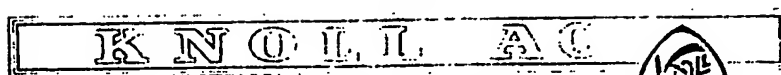


2614020

Überzogene Tabletten, die aus den nach dem neuen Verfahren isolierten Presslingen hergestellt sind, zeigen eine sehr gute Widerstandsfähigkeit gegen Feuchtigkeit. Ein besonderer Vorteil des neuen Verfahrens besteht darin, dass die übrigen galenischen Eigenschaften (Härte, Zerfallszeit u.ä.) der überzogenen Tabletten praktisch nicht verändert werden.

709842/0088

- 4 -



CHEMISCHE FABRIKEN



2614020

B e i s p i e l

9.800 Ascorbinsäure-Presslinge, bestehend aus je 50 mg Ascorbinsäure, 200 mg Lactose, 5 mg Maisstärke und 1,25 mg Magnesiumstearat, werden in einem Dragierkessel mit 50 g einer Mischung aus durch Destillation gereinigten acetylierten Monoglyceriden (Myvacet[®] 9-40) besprüht und mit 2,5 g fein gepulvertem hydriertem Ricinusöl (Cutine[®] HR) bestreut. Anschliessend lässt man den Kessel mit den Presslingen 5 Minuten rotieren. Danach werden die Kerne mit einer Suspension aus 1,0% Carboxymethylcellulose, 1,0% Polyvinylpyrrolidon (Kollidon[®] 25), 50,0% Saccharose, 1,0% fein disperse Kieselsäure, 6,8% Talkum, 2,5% Calciumcarbonat, 2,0% Gummi Arabikum, 6,0% Farblack und 29,7% Wasser überzogen.

Die gemäss dem Beispiel erhaltenen Dragées wurden mit solchen gleicher Zusammensetzung, jedoch ohne Isolierschicht, verglichen. Nach einer Lagerzeit von 4 Wochen bei 40°C betrug der Ascorbinsäuregehalt in den erfindungsgemäss überzogenen Dragées 99,3%, während er bei den anderen auf 93,2% abgesunken war. Die Zerfallzeit im Magensaft blieb bei den zuerst genannten Dragées konstant bei 2 - 3 Minuten, während sie bei den anderen auf 4 - 6 Minuten zunahm.

709842/0088

- 5 -